

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成24年9月27日 (2012.9.27)

【公表番号】特表2012-500205(P2012-500205A)

【公表日】平成24年1月5日 (2012.1.5)

【年通号数】公開・登録公報2012-001

【出願番号】特願2011-523131(P2011-523131)

【国際特許分類】

C 0 7 C 233/78 (2006.01)

C 0 7 C 235/50 (2006.01)

C 0 7 D 307/68 (2006.01)

A 6 1 K 31/341 (2006.01)

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 27/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 233/78 C S P

C 0 7 C 235/50

C 0 7 D 307/68

A 6 1 K 31/341

A 6 1 K 31/166

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 27/06

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 27/04

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/06

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 19/02

## 【手続補正書】

【提出日】平成24年8月7日(2012.8.7)

## 【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

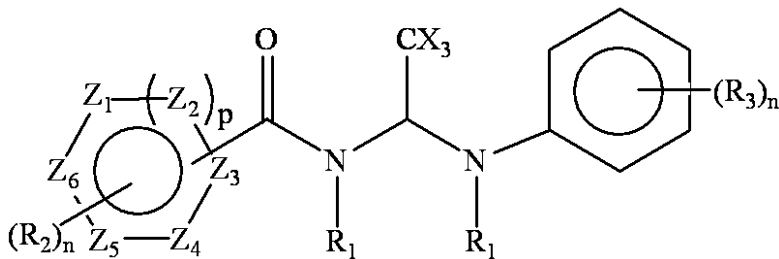
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記の構造を有する化合物またはその製薬上許容し得る塩：

【化 1】



(式中、各 $R_1$ は、個々に、Hまたは低級アルキルであり；

各 $R_2$ は、個々に、メチル以外の直鎖または枝分れ鎖のアルキル、シクロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、Cl、Br、I、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、アルキルカルボキシル、トリフルオロメチル、 $N(R_4)_2$ 、CN、 $CO_2R_4$ 、 $CH_2OH$ 、 $OCF_3$ 、 $OCHF_2$ または $NO_2$ であり；各 $R_2$ は、カルボニル成分に対してメタ またはパラ 位置にあり；

各 $R_3$ は、個々に、直鎖または枝分れ鎖のアルキル、シクロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、Cl、Br、I、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、アルキルカルボキシル、トリフルオロメチル、 $N(R_4)_2$ 、CN、 $CO_2R_4$ 、 $CH_2OH$ 、 $OCF_3$ 、 $OCHF_2$ または $NO_2$ であり；

各 $R_4$ は、個々に、H、直鎖または枝分れ鎖のアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ハロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルキルカルボニル、ホルミル、オキシカルボニル、カルボキシル、アルキルカルボキシレート、アルキルアミド、アミノ、アルキルアミノまたはアミノカルボニルであり；

$Z_1$ 、 $Z_2$ 、 $Z_3$ 、 $Z_4$ 、 $Z_5$ および $Z_6$ は、各々、個々に、Cであるか又はその1つがNであり；

Xは、F、Cl、BrまたはIであり；

各nは、個々に、1~5であり；そして、

pは、1である。

【請求項 2】

前記Xが、F、ClまたはBrである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

前記各 $R_2$ が、個々に、アルキル、Cl、Br、I、アルコキシまたは  $NO_2$ である、請求項 2 記載の化合物。

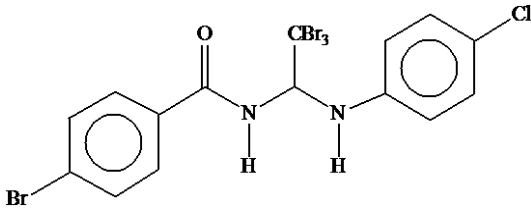
【請求項 4】

pが1であり、 $Z_1$ 、 $Z_2$ 、 $Z_3$ 、 $Z_4$ 、 $Z_5$ および $Z_6$ が、各々、Cである、請求項 1 記載の化合物。

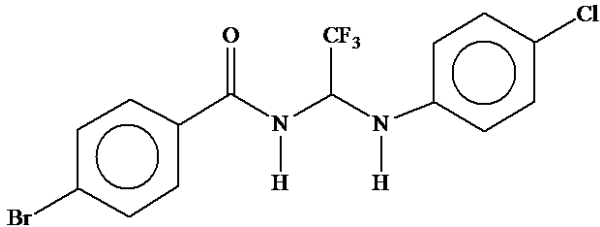
【請求項 5】

下記の構造のいずれか 1 つを有する、請求項 4 記載の化合物：

## 【化 2】



## 【化 3】



又は、(-)-5-ブロモ-N-(2,2,2-トリクロロ-1-(4-クロロフェニルアミノ)エチル)ピコリンアミド。

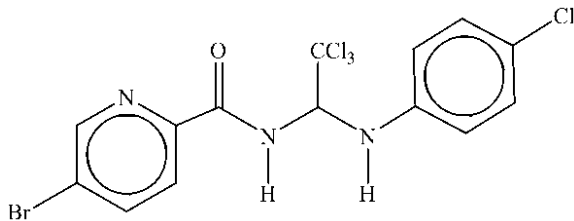
## 【請求項 6】

p が 1 であり、 $Z_1$ 、 $Z_2$ 、 $Z_3$ 、 $Z_4$ 、 $Z_5$  および  $Z_6$  の 1 つが N である、請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 7】

下記の構造を有する、請求項 6 記載の化合物：

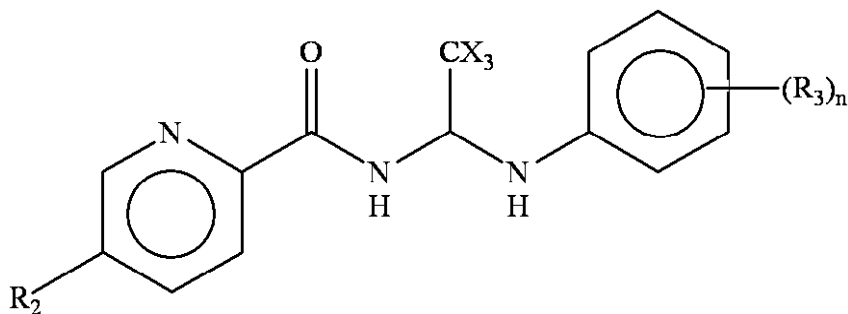
## 【化 4】



## 【請求項 8】

下記の構造を有する、請求項 1 記載の化合物：

## 【化 5】



(式中、X は、Cl、F または Br であり；

$R_2$  は、メチル以外の直鎖または枝分れ鎖のアルキル、シクロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、Cl、Br、I、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、アルキルカルボキシル、トリフルオロメチル、 $N(R_4)_2$ 、CN、 $CO_2R_4$ 、 $CH_2OH$ 、 $OCF_3$ 、 $OCHF_2$  または  $NO_2$  であり；

各  $R_3$  は、個々に、直鎖または枝分れ鎖のアルキル、シクロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、Cl、Br、I、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、アルキルカルボキシル、トリフルオロメチル、 $N(R_4)_2$ 、CN、 $CO_2R_4$ 、 $CH_2OH$ 、 $OCF_3$ 、 $OCHF_2$  または  $NO_2$  であり；

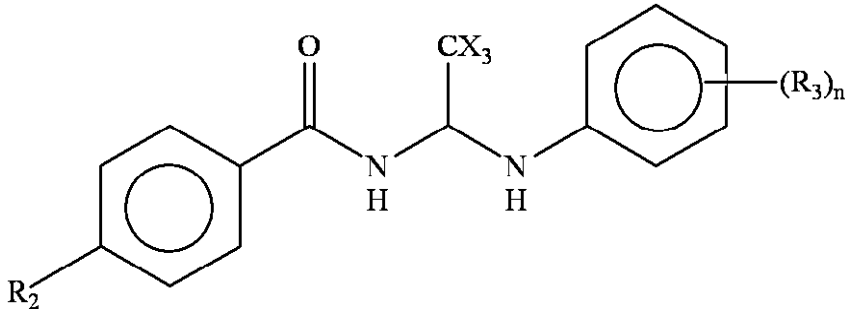
各  $R_4$  は、個々に、H、直鎖または枝分れ鎖のアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ハロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルキル

カルボニル、ホルミル、オキシカルボニル、カルボキシル、アルキルカルボキシレート、アルキルアミド、アミノ、アルキルアミノまたはアミノカルボニルであり；そして、  
nは、1～5である）。

【請求項 9】

下記の構造を有する、請求項 1 記載の化合物：

【化 6】



(式中、Xは、Cl、FまたはBrであり；

R<sub>2</sub>は、メチル以外の直鎖または枝分れ鎖のアルキル、シクロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、Cl、Br、I、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、アルキルカルボキシル、トリフルオロメチル、N(R<sub>4</sub>)<sub>2</sub>、CN、CO<sub>2</sub>R<sub>4</sub>、CH<sub>2</sub>OH、OCF<sub>3</sub>、OCHF<sub>2</sub>またはNO<sub>2</sub>であり；

R<sub>3</sub>は、個々に、直鎖または枝分れ鎖のアルキル、シクロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、アルケニル、アルキニル、Cl、Br、I、ヒドロキシ、アルコキシ、アルキルアミノ、アルキルカルボキシル、トリフルオロメチル、N(R<sub>4</sub>)<sub>2</sub>、CN、CO<sub>2</sub>R<sub>4</sub>、CH<sub>2</sub>OH、OCF<sub>3</sub>、OCHF<sub>2</sub>またはNO<sub>2</sub>であり；

各R<sub>4</sub>は、個々に、H、直鎖または枝分れ鎖のアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ハロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ヒドロキシアルキル、アルキルカルボニル、ホルミル、オキシカルボニル、カルボキシル、アルキルカルボキシレート、アルキルアミド、アミノ、アルキルアミノまたはアミノカルボニルであり；そして、  
nは、1～5である）。

【請求項 10】

請求項 1 の少なくとも 1 種の化合物を、それ用の製薬上許容し得る担体中に含む、製薬組成物。

【請求項 11】

疼痛、ドライアイ、血管形成障害、または創傷治癒から選択される疾患の治療のための製薬組成物の調製における請求項 1 記載の化合物の使用。

【請求項 12】

前記疾患が、慢性疼痛である、請求項 11 記載の使用。

【請求項 13】

前記疾患が、急性疼痛である、請求項 11 記載の使用。

【請求項 14】

前記製薬組成物が経口投与用である、請求項 11 記載の使用。